

**This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record**

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representation of
The original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

⑨ 日本国特許庁 (JP) ⑩ 特許出願公開
 ⑪ 公開特許公報 (A) 昭55-124763

⑫ Int. Cl.³
 C 07 D 213/64
 213/70

識別記号 庁内整理番号
 7138-4C
 7138-4C

⑬ 公開 昭和55年(1980)9月26日
 発明の数 1
 審査請求 未請求

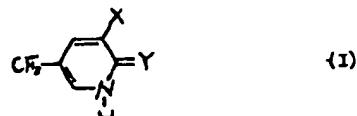
(全 3 頁)

⑭ 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体
 ⑮ 特 願 昭54-32068
 ⑯ 出 願 昭54(1979)3月19日
 ⑰ 発明者 西山隆三
 高槻市真上町5丁目41番22号
 ⑱ 発明者 藤川敢一
 守山市浮気町321番地の31
 ⑲ 発明者 横道勲
 草津市野村町221番地

⑲ 発明者 芳賀隆弘
 草津市野村町221番地
 ⑳ 発明者 長谷邦昭
 守山市浮気町321番地の31
 ㉑ 発明者 林弘仁
 守山市浮気町321番地の31
 ㉒ 出願人 石原産業株式会社
 大阪市西区江戸堀1丁目3番11
 号

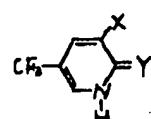
明細書

1. 発明の名称 5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体



(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体である。

前記一般式(I)の5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体は、次に示すような互変異性として存在することができる。

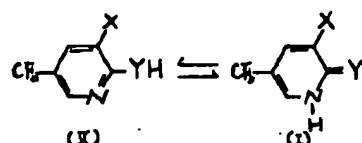


(式中Xは水素原子又はハロゲン原子であり、Yは酸素原子又はイオウ原子である。但し、Xが水素原子の場合、Yはイオウ原子である。)で表わされる5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体。

2. 発明の詳細な説明

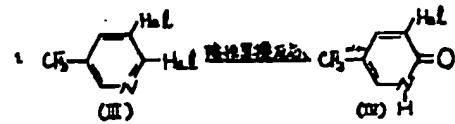
本発明は医薬、農薬、染料などの中间原料として有用で、新規な5-トリフルオロメチル-2-ピリドン誘導体に関する。

詳しくは本発明は一般式



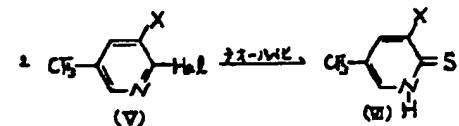
(式中X及びYは前述の通りである)
 前記一般式(I)において、Xで表わされるハロゲン原子としてはヨウ素、塩素、臭素、硫黄が用いられる。

本発明の5-トリフルオロメチル-2-ヒリドン誘導体は通常、例えば下記方法によって製造される。



(上記反応式中 BaS はハロゲン原子である)

一般に上記反応はジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの弱プロトン性極性溶媒中、水酸化ナトリウム、水酸化カリウムなどのフルカリ水溶液を用いて50～150℃、0.1～10時間で行なわれる。



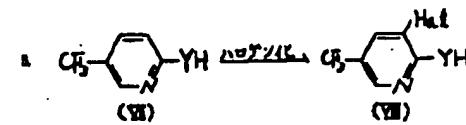
(上記反応式中 X 及び H₂S は前述の通りである)

一般に上記反応はノタノール、エタノールなどのアルコール類、ジメチルスルホキシド、ジメチルホルムアミドなどの好プロトン性極性溶

- 3 -

MM 35-124763(2)

無など 常温中、チオ尿素、溴化ソーダ、チオ硫酸ソーダ、N,N-ジメチルジチオカルバミン酸ソーダなどのチオール化剤を用いて50~
還流温度0.5~1.0時間で行なわれる。

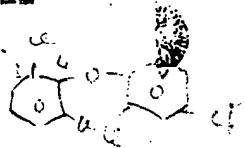


(上記反応文中 Y 及び H₂S は前述の通りである)

一般に上記反応は四塩化炭素、クロロホルム、酢酸、二硫化炭素、水、非プロトン性極性溶媒などの溶媒中、複数ガス、臭素、チオニルクロライド、スルフリルクロライドなどのハロゲン化剤を用いて0～100℃、0.5～10時間で行なわれる。

本発明化合物は、例えばハログン化ニトロペ
ンゼン類と結合させて 4-(5-トリフルオロメチルビリジン-2-イルオキシ)ニトロベン
ゼン類を生成させ、これを還元して得られる 4-
-(5-トリフルオロメチルビリジン-2-イル
オキシ)アニリン類とベンゾイルイソシアニ

- 4 -



死虫率が得られた。

次に本発明化合物の具体的合成例を記載する。

合成例 1 3-クロロ-5-トキフルオロメチル-2-ヒドン

[A]

5-トリフルオロメチル-2-ヒドリド α -Q₁
2タをクロロホルム 20 ml に溶解させ、50
℃に加温して塩素ガスを1時間搅拌下に通じ
た。反応終了後、クロロホルムを留去し、ト
ルエン-クローヘキサンの混合溶媒で再結晶し
て融点 144~147℃の目的物 0.15 g を
得た。

1 B

水酸化ナトリウム 2.4 g を水 1.25 ml に溶解させた水溶液に 2,3-ジクロロ-5-トリフルオロメチルビリジン 4 g を加え、更にジメチルスルホキシド 1.25 ml を加えて加熱し、110°C で 1 時間攪拌下に反応させた。反応終了後生成物を放置し、微粒膜で酸性にして沈殿物を得、このものを撫過して目的物 2.5

ト酸とを反応させることによりN-ベンゾイ
ル-N'-[4-[5-トリフルオロメチルビリ
ジン-2-イルオキシ]フェニル]ウレア系化
合物に誘導できる。詳しくは本発明化合物の3
-クロロ-5-トリフルオロメチル-2-ビリ
フンと3,4,5-トリクロロニトロペンゼンとを
結合、還元して3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-
イルオキシ)アニリンを得、更にこのものと2
6-ジフルオロベンゾイルイソシアネートとを
反応させると、N-[2,6-ジフルオロベンゾ
イル]-N-[3,5-ジクロロ-4-(3-ク
ロロ-5-トリフルオロメチルビリジン-2-
イルオキシ)フェニル]ウレアを得ることができる。
このものは農業用の有効成分として優れ
た活性を示し、種々の有害虫、特に有害昆蟲の
防除に有効であって、例えばこの化合物²100
ppm水分散液にキバウツの葉片を浸漬し、それ
を風乾してそこへ2~3合のコナガの幼虫を散
らし、8日目に生死を判定した結果、100%の

- 8 -

- 6 -

を得た。

合成例 2 5-トリフォルオロメチル-2-チオ
ピリドン

2-クロロ-5-トリフォルオロメチルヒリ
ジン 4 g とチオ尿素 16.7 g をエタノール
30 ml に溶解させ、加熱して還流状態で 3 時
間攪拌下に反応させた。その後、水酸化カリ
ウム水溶液 12.3 g を徐々に加えて還流状態
で 1 時間反応させた。反応終了後、生成物を
放冷し、希アルカリ水溶液中に投入して塩化
メチレンで洗浄し、酢酸で酸性にした。次い
で、塩化メチレンで抽出し、抽出層を水洗後
無水硫酸ナトリウムで乾燥させ、塩化メチレ
ンを留去して融点 147~150 °C の目的物
2.1 g を得た。

合成例 3 3-ブロモ-5-トリフォルオロメチ
ル-2-ピリドン

5-トリフォルオロメチル-2-ピリドン 0.
4 g を酢酸 10 ml に溶解させ、そこへ臭素 0.
4 g を加えて攪拌下で 4 時間反応させた。反

特許昭55-124763(3)

反応終了後、酢酸を留去し、塩化メチレン 10
ml-ヘキサンの混合溶媒で再結晶して融点 162
~165 °C の目的物 0.45 g を得た。

合成例 4 3-クロロ-5-トリフォルオロメチ
ル-2-チオピリドン

2-クロロ-5-トリフォルオロメチルヒリ
ジン 4 g に代えて 2,3-ジクロロ-5-トリフォ
ルオロメチルヒリジン 4.75 g を用いる以外
は前記合成例 2 と同様にして反応を行ない、
後処理を行なって融点 125~128 °C の目
的物 1.9 g を得た。

特許出願人 石原産業株式会社